



特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 3125WOOP	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/15535	国際出願日 (日.月.年) 04.12.2003	優先日 (日.月.年) 05.12.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> C07D279/08, A61K31/5415, A61P9/00, 13/12, 19/00, 25/00, 29/00, 31/00, 35/00, 37/00, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 武田薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 8 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a ☐ 附属書類は全部で \_\_\_\_\_ ページである。

☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b ☐ 電子媒体は全部で \_\_\_\_\_ (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎

☐ 第II欄 優先権

☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不成

☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如

☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

☒ 第VI欄 ある種の引用文献

☐ 第VII欄 国際出願の不備

☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 08.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 18.06.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 田名部 拓也	4P 9738
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

## 第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
☐ PCT規則12.4にいう国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、 出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、 出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、 出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☒ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 10, 18

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 18 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。  
ヒトの治療方法に係る発明が記載されている。

☒ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 10 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。  
請求項1記載の化合物の「プロドラッグ」に、具体的にどのような化合物が含まれるのか不明である。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 10, 18 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐

提出されていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐

所定の基準を満たしていない。

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)

請求の範囲

請求の範囲 1-9, 11-17, 19

有  
無

進歩性(IS)

請求の範囲

請求の範囲 1-9, 11-17, 19

有  
無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲

請求の範囲 1-9, 11-17, 19

有  
無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 02/18356 A1 (武田薬品工業株式会社) 2002.03.07

2位に「置換基を有していてもよい炭化水素基、置換基を有していてもよい芳香族複素環基または置換基を有していてもよいアミノ基」を有する4H-1, 3-ベンゾチアジン-4-オン(本国際出願の請求項の一般式で示される化合物と重複する化合物である)が心筋細胞アポトーシス抑制作用を有すること;それにより斯かる化合物が心疾患の予防、治療作用を有することが記載されている。

文献2: WO 02/44157 A2 (ICONIX PHARMACEUTICALS INC.) 2002.06.06

本国際出願の請求項の一般式で示される化合物と重複する化合物(斯かる一般式で、R<sup>2</sup>が-CH<sub>2</sub>-CONH<sub>2</sub>の化合物も具体的に示されている)が、PARP阻害活性を有することが記載されている。

文献3: JP 3-229241 A (富士写真フイルム株式会社) 1991.10.11

2位に「置換されていてもよいアルキル基、アリール基」を有する4H-1, 3-ベンゾチアジン-4-オン(本国際出願の請求項の一般式で示される化合物と重複する化合物である)が記載されている。

文献4: US 3470168 A (American Home Products Corporation) 1969.09.30

2位に各種の「アミノ基」を有する4H-1, 3-ベンゾチアジン-4-オンが記載されている。

文献5: GADE, T., 他, "Electroreduction of organic compounds. 19. Formation of benzoannelated sulfur heterocycles by intramolecular cathodic cyclization of dithiocarboxylic esters", Chemische Berichte (1992), 125(1), 127-41

2位にt-Bu基を有する4H-1, 3-ベンゾチアジン-4-オンが記載されている。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/90782 A1 (武田薬品工業株式会社) EX	06. 11. 2003	24. 04. 2003	26. 04. 2002
WO 03/20719 A1 (武田薬品工業株式会社) EX	13. 03. 2003	02. 09. 2002	03. 09. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲において、「プロドラッグ」と記載するものであるが、いかなる化合物がその範囲に包含されるのか不明瞭である。

配列表に関する補充欄

第 I 欄 2. の続き

1. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に必要なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき国際予備報告を作成した。

a. タイプ ☒ 配列表

☐ 配列表に関連するテーブル

b. フォーマット ☒ 書面

☒ コンピュータ読み取り可能な形式

c. 提出時期 ☒ 出願時の国際出願に含まれる

☒ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された

☐ 出願後に、調査又は予備審査のために、この国際機関に提出された

☐ \_\_\_\_\_ 付けで、この国際予備審査機関が補正\*として受理した

2. ☒ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

3. 補足意見：

\*第 I 欄 4. に該当する場合、差替える配列表又は配列表に関連するテーブルに “superseded” と記入されることがある。

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

文献 6 : WO 99/11649 A2 (GUILFORD PHARMACEUTICALS INC.) 1999.03.11

PARP 阻害剤が、心疾患の防御作用を有することが記載されている (「Field of the Invention」の項)。

\*請求の範囲 : 1 - 8

請求の範囲 1 - 8 に記載の発明は、国際調査報告書で引用した文献 1 ~ 3, 5 に対して新規性、進歩性を有しない。また、文献 1 ~ 5 に対して進歩性を有しない。

文献 1 ~ 3, 5 には、本願の一般式で記載される化合物と重複する化合物が記載されている。

\*請求の範囲 : 9, 11 - 17, 19

請求の範囲 9, 11 - 17, 19 に記載の発明は、国際調査報告で引用した文献 1, 2, 6 に対して新規性、進歩性を有しない。

文献 1 には、本国際出願の請求の範囲に一般式で示される化合物が「マクロファージ遊走阻止因子結合剤」として機能することは記載されていない。しかしながら、本国際出願は心筋細胞死の抑制など心臓疾患に対する効果を主張するものであるところ、文献 1 では斯かる化合物が心疾患の抑制作用を有することが示されている。そうしてみると、本国際出願に記載の発明と文献 1 に記載の発明とに実質的な差異を認めることができない。

また、文献 2 にも、本国際出願の請求の範囲に一般式で示される化合物が「マクロファージ遊走阻止因子結合剤」として機能することは記載されていない。しかしながら、文献 2 に記載の PARP 活性阻害作用により心疾患の抑制がもたらされることは文献 6 から明らかであるから、同様に、本国際出願に記載の発明と文献 2 に記載の発明とに実質的な差異を認めることができない。